

ANTI-INFLAMMATORY AGENT

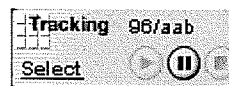
Patent number: JP62145015
Publication date: 1987-06-29
Inventor: ITO YASUYOSHI; MATSUDA RYOZO
Applicant: KOTOBUKI CHEM KK
Classification:
- international: **C07H7/027; A61K31/17; A61P29/00; C07H7/00; A61K31/17; A61P29/00; (IPC1-7): A61K31/17; C07H7/027**
- european:
Application number: JP19850287314 19851219
Priority number(s): JP19850287314 19851219

Report a data error here

Abstract of JP62145015

PURPOSE:To provide an anti-inflammatory agent containing sialic acid as an active component.
CONSTITUTION:The objective anti-inflammatory agent contains sialic acid, especially N-acetylneuraminic acid as an active component. Sialic acid is rich in placenta extract and is an important component of an animal polysaccharide. It can be administered by oral administration, injection or external application in the form of tablet, pill, suspension, emulsion, suppository, injection, ointment, etc. Dose, 10-2,000mg/kg daily, preferably 100-1,000mg/kg daily.

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide

DELPHION**RESEARCH****PRODUCTS****INSIDE DELPHION****Log Out****Work Files****Saved Searches**

My Account

Search: Quick/Number Boolean Advanced Der

Derwent Record

✉ En

View: [Expand Details](#) Go to: [Delphion Integrated View](#)Tools: Add to Work File: [Create new Work File](#)

Derwent Title: **Antiinflammatory agent - comprises sialic acid as active ingredient, esp. N-acetyl:neuraminic acid**

Original Title: ☒ **JP62145015A2: ANTI-INFLAMMATORY AGENT**

Assignee: **KOTOBUKI CHEM KK** Standard company
Other publications from [KOTOBUKI CHEM KK \(KOTO\)](#)...

Inventor: **None**

Accession/ **1987-218321 / 198731**

Update:

IPC Code: A61K 31/17 ; C07H 7/02 ;

Derwent Classes: **B03;**

Manual Codes: **B07-A02**(Tetrahydro-(furan or pyran) [general]) , **B12-D07**
(Antiinflammatory)

Derwent Abstract: ([JP62145015A](#)) The agent can be formed into oral preps, injections, or external use, e.g. tablets, pills, aq solns, suspensions, emulsions, capsules, suppositories, injections, or ointment.
These preps can be formed using diluting agents, such as filling agents, bulking agents, binding agents, wetting agents, disintegrators, or lubricants by the known method.
The amt of the antiinflammatory agent administered is 10-2,000 mg/kg of body wt/day for adults, pref. 100-1,000 mg/kg/day depending on patient's age, body weight, or symptoms.
USE/Advantage - An antiinflammatory agent whose active ingredients is sialic acid, partic. N-acetylneuraminic acid, is obtd.

[Dwg.0/0](#)

Family: **PDF Patent Pub. Date Derwent Update Pages Language IPC Code**

☒ **JP62145015A** * 1987-06-29 198731 3 English A61K 31/17

Local appls.: [JP1985000287314](#) Filed:1985-12-19 (85JP-0287314)

Priority Number:

Application Number	Filed	Original Title
JP1985000287314	1985-12-19	ANTI-INFLAMMATORY AGENT

Chemical Indexing Codes: [Show chemical indexing codes](#)

Registry Numbers: **01[M2]:87140 1286M**

Title Terms: **ANTIINFLAMMATORY AGENT COMPRISE SIALIC ACID ACTIVE INGREDIENT N ACETYL NEURAMINIC ACID**

⑩ 日本国特許庁(JP)

⑪ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A)

昭62-145015

⑬ Int.Cl.⁴

識別記号

庁内整理番号

⑭ 公開 昭和62年(1987)6月29日

A 61 K 31/17
// C 07 H 7/027

ABE

6971-4C

審査請求 未請求 発明の数 1 (全3頁)

⑮ 発明の名称 抗炎症剤

⑯ 特 願 昭60-287314

⑰ 出 願 昭60(1985)12月19日

特許法第30条第1項適用 昭和60年7月20日 ライフ・サイエンス出版株式会社発行の「薬理と治療
第13巻第7号」に掲載して発表

⑱ 発 明 者 伊 東 崇 美 八幡市西山丸尾4番地2

⑲ 発 明 者 松 田 良 蔵 大阪市淀川区新北野1-11-23

⑳ 出 願 人 株式会社 壽ケミカル 大阪市東区内本町1丁目38番地

㉑ 代 理 人 弁理士 青 山 葆 外1名

明 細 書

1. 発明の名称

抗炎症剤

2. 特許請求の範囲

(1) シアル酸を有効成分として含有することを特徴とする抗炎症剤。

(2) シアル酸がN-アセチルノイラミン酸である前記第1項記載の抗炎症剤。

3. 発明の詳細な説明

産業上の利用分野

本発明は新規な抗炎症剤、さらに詳しくはシアル酸、とくにN-アセチルノイラミン酸を有効成分とする抗炎症剤に関する。

技術的背景と先行技術

哺乳動物の胎盤抽出物、ブラセンタエキスには種々の薬理活性成分が含まれ、そのために医薬品、化粧品などに配合されている。このブラセンタエキスには、動物の種類によっても多少変動があるが、多くのアミノ酸類、ビタミン類、無機成分、アルカリホスファターゼ、デオキシリボ核酸、中

性コレステロイドなどが含まれていることが知られている。

発明の目的

本発明者らは、永年、ブラセンタエキス、とくにウシのブラセンタエキスの薬理活性、有効成分などについて研究を重ね、今回、そのブラセンタエキスにシアル酸がN-アセチルノイラミン酸の形で含まれていることを発見し、このシアル酸に注目し、その薬理活性について種々検討した。その結果、シアル酸にすぐれた抗炎症作用があることを知り本発明を完成した。

すなわち、本発明はシアル酸、とくにN-アセチルノイラミン酸を有効成分とする抗炎症剤を提供するものである。

発明の構成および効果

本発明の抗炎症剤における有効成分であるシアル酸は本発明者らによりブラセンタエキス中に含まれることが見出されたが、このシアル酸とはノイラミン酸のアシル誘導体の一群を意味し、多くの動物多糖類の重要成分であることが知られて

おり、その主な一種であるN-アセチルノイラミン酸は試薬などとしてすでに市販に供されている。本発明にはいずれのシアル酸も含むが、とくにN-アセチルノイラミン酸が好ましい活性成分として用いられる。

本発明者らの実験によれば、シアル酸(N-アセチルノイラミン酸)は下記のような薬理学的および生化学的作用を示す。

(1) 抗炎症作用

市販のN-アセチルノイラミン酸を用い、ラットにおけるカラゲニン誘発浮腫に対する抑制作用を実験した。なお、対象薬物としてアスピリンを用いた。

(i) 実験1

方法:

ウイスター系雄ラット(体重130~162g、1群7匹)を室内(温度23±1℃、湿度55±5%)に保ち、1週間固型飼料(CE-2、日本クリア社製)および飲料水を与えて飼育した。これにN-アセチルノイラミン酸(SIA)30、100、

300、500または1000mg/kgのグッド緩衝液(pH6.4)[Good N.E., バイオケミストリ(Biochemistry), 5, 467~476(1966)]の溶液を皮下注射した。ついで、1%カラゲニン生理食塩水溶液0.1mlを動物の右後肢の足趾へ注射してカラゲニン浮腫を誘発させた。注射後30分~24時間に亘って浮腫を観察した。

結果:

得られた浮腫率を添付の第1図に示す。また、その浮腫率よりN-アセチルノイラミン酸(SIA)の浮腫抑制率を算出すると下記第1表に示すとおりである。

第1表 (抑制率%)

SIA 投与量 (mg/kg)	カラゲニン注射後の時間							
	30分	1hr	2hr	3hr	4hr	5hr	6hr	24hr
30	3.3	4.5	1.8	6.4	4.0	1.8	3.1	2.9
100	16.7	22.9	10.8	12.5	9.4	13.3	13.8	8.9
300	19.3	27.4	23.8	23.9	28.6	22.0	26.4	24.0
500	26.8	31.5	9.0	20.0	25.0	30.5	22.5	35.7
1000	44.2	29.6	19.4	24.5	34.8	28.9	28.1	36.5

(ii) 実験2

シアル酸とアスピリンとの効果を比較するため、前記実験1と同様にして、ラットにN-アセチルノイラミン酸(SIA)300mg/kgおよび対照としてアスピリン100mg/kgのグッド緩衝液(pH6.4)の溶液を皮下注射したのち、カラゲニンによる浮腫誘発を行なった。

その浮腫率を第2図に示す。また、その浮腫率より浮腫抑制率を算出すると下記第2表に示すとおりである。

第2表 (抑制率%)

薬物投与量 (mg/kg)	カラゲニン注射後の時間							
	30分	1hr	2hr	3hr	4hr	5hr	6hr	24hr
SIA 300	5.5	5.0	16.5	26.5	27.4	31.2	26.0	38.1
アスピリン100	29.3	23.6	39.1	35.4	44.8	29.8	30.8	3.8

上記結果から明らかなように、N-アセチルノイラミン酸300mg/kg以上でかなりの浮腫抑制率を示し、またアスピリンに比べて作用持続性を示した。

2. 急性毒性

ddY系雄マウス(体重22~30g、1群10匹)にN-アセチルノイラミン酸100、300、1000および5000mg/kgのグッド緩衝液(pH6.4)の溶液を皮下注射し、1週間一般症状を観察し、また投与後24時間、アーウィン(Irwin)の変法[サイコファルマコロジー(Psychopharmacologia), 13, 222~257(1968)]に準じて行動症状を観察した。その結果、死亡例は1例も認められず、また中枢および自律神経系へ

特開昭62-145015(3)

の影響も認められなかった。これより、N-アセチルノイラミン酸の急性毒性、LD₅₀は500mg/kg以上であり、毒性はきわめて低く安全であることがわかる。

本発明の抗炎症剤は、経口投与、注射、外用のいずれの投与形態でも用いられ、一般的な医薬製剤、例えば錠剤、丸剤、溶液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤、カプセル剤、坐剤、注射剤、軟膏剤などの種々の剤形が採用される。これらの製剤は通常使用される充填剤、増量剤、結合剤、付着剤、崩壊剤、滑沢剤などの賦形剤、希釈剤を用いて常法により製造される。なお本発明の抗炎症剤には他の公知の抗炎症活性薬物を適宜配合してもよい。

本発明の抗炎症剤における活性成分のシアル酸の用量は、患者の年齢、体重、さらに症状の程度などによっても多少変動するが、通常、ヒトの大人において、10~2000mg/kg/日、好ましくは100~1000mg/kg/日の投与量にて用いられる。

つぎに実施例により本発明の抗炎症剤をさらに

具体的に説明するが本発明はこれらに限定されない。

実施例1

錠剤

成 分	用 量
N-アセチルノイラミン酸	100mg
アスピリン	100mg
乳糖	200mg
乾燥デンプン	200mg
ステアリン酸マグネシウム	50mg

常法により1錠中に上記組成を有する錠剤を調製する。

実施例2

注射剤

成 分	用 量
N-アセチルノイラミン酸	100mg
グッド緩衝液	計1000ml

常法により上記組成からなる注射剤を調製する。

実施例3

軟膏剤(O/W型)

成 分	用 量
流動パラフィン	9.00重量%
ステアリン酸	4.00 "
セタノール	3.00 "
モノステアリン酸ポキオキシ	
エチレンソルビタン(20EO)	0.50 "
シリコン樹脂	0.50 "
N-アセチルノイラミン酸	3.00 "
プロピレングリコール	18.00 "
パラオキシ安息香酸メチル	0.20 "
アヤコールLC-ワックス	3.00 "
精製水	58.50 "

常法により上記組成からなる軟膏剤を調製する。

4. 図面の簡単な説明

第1図はカラゲニン誘発浮腫に対するN-アセチルノイラミン酸の浮腫抑制活性(抗炎症活性)を示すグラフ、第2図は、N-アセチルノイラミン酸および対照のアスピリンの抗カラゲニン誘発浮腫活性を示すグラフである。

